

APPLICATION AGENT FOR GUM MUCOSA

Patent number: JP58213709
Publication date: 1983-12-12
Inventor: KAWADA TERUSHIGE; YAMASHITA SHINSUKE
Applicant: TEIKOKU SEIYAKU KK
Classification:
- International: A61K9/00
- european:
Application number: JP19820096805 19820605
Priority number(s): JP19820096805 19820605

Abstract of JP58213709

PURPOSE: The titled application agent capable of being kept in the oral cavity for a long time without being affected by the influence of spittle, absorbing a drug in the gum effectively, obtained by laminating a composition containing a water-soluble or water-swelling high polymer and the drug to a flexible substrate in a sheet form. **CONSTITUTION:** A composition containing a water-soluble or water-swelling high polymer substance and a drug is laminated to a flexible substrate (e.g., nonwoven fabric, plastic film), to give the titled application agent. A combination of gelatin, agar, etc. having gel-forming ability and polyvinyl alcohol, polyvinyl pyrrolidone, cellulose derivative, etc. having film-forming ability is preferable as the high polymer substance. Not only a remedy for pyorrhea alveolaris, stomatitis, etc. but also nitroglycerin, etc. may be used as the drug. Consequently, it can be used as a preventive for angina pectoris, etc., and the application agent is useful not only for the surroundings of the gum, but also for a preventive and remedy for diseases of the whole body.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

⑯ 公開特許公報 (A)

昭58-213709

⑤ Int. Cl.³
A 61 K 9/00

識別記号

庁内整理番号
7057-4C

④公開 昭和58年(1983)12月12日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 6 頁)

⑤ 齒肉粘膜用貼付剤

⑥ 特 願 昭57-96805

⑦ 出 願 昭57(1982)6月5日

⑧ 発明者 河田照茂

徳島市八万町下福万128-71

⑨ 発明者 山下伸典

徳島市八万町大坪221-1

⑩ 出願人 帝國製薬株式会社

香川県大川郡大内町三本松567

番地

⑪ 代理人 弁理士 青山葆 外1名

明 細 書

1. 発明の名称

歯肉粘膜用貼付剤

2. 特許請求の範囲

(1) 柔軟性のある支持体上に水溶性または水膨潤性高分子物質の1種または2種以上から主となる組成物に薬物を配合した薬剤層用組成物をシート状に横層して薬剤層を成形させたことを特徴とする歯肉粘膜用貼付剤。

(2) 該水溶性または水膨潤性高分子物質がポリビニルアルコール、ゼラチン、寒天、デンプン、キサンタンガム、アラビアゴム、トラガカントゴム、カラヤゴム、エコーガム、ローカストビーンガム、アルギン酸ナトリウム、ベクチン、メチルセルロース、エチルセルロース、デロビルセルロース、エチルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシセルロース、カルボキシメチルセルロース、セルロースアセテートフタレート、メチルビニルエステル、ポリビニルピロリドン、カルボキシビニルポリマー、カゼイン、アルブミ

ン、キチン、ポリアクリル酸ナトリウムおよびその架橋体から選ばれる前記第(1)項の貼付剤。

(3) 該水溶性または水膨潤性高分子物質が、ゼラチン、寒天、アルギン酸ナトリウムから選ばれるゲル形成能を有する高分子物質の1種または2種以上と、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、セルロース誘導体から選ばれるフィルム形成能を有する高分子物質の1種または2種以上の組合せからなる前記第(1)項の貼付剤。

(4) 該薬剤層が水分含量20%以下まで乾燥されている前記第(1)項の貼付剤。

(5) 該薬剤層用組成物に、グリセリン、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、1,3-ブタンジオールおよびソルビトールから選ばれる軟化剤の1種または2種以上を該組成物全量に基づいて0~70重量%配合した前記第(1)~(4)項のいずれか1つの貼付剤。

3. 発明の詳細な説明

本発明は歯肉粘膜用貼付剤、さらに詳しくは柔軟性支持体上に薬物を含有させた薬剤層をシート

状に成形してなり、歯肉粘膜によく接着し、唾液などにより溶解、崩壊して飲み下される恐れがなく長時間歯肉上に保持されうる歯肉粘膜用貼付剤に関する。

従来より、口腔内疾患、例えば歯槽膿漏、口内炎、歯痛などに対し種々の薬物を軟膏、液剤などの形で局所塗布されているが、このような方法では塗布後、短時間のうちに唾液などに溶解して飲み下されてしまい長時間の薬効が期待できない。また口腔粘膜からの薬物吸収を目的としてトローチ剤、バッカル剤なども用いられており、そのうちトローチ剤は主として口腔内疾病に対して局所的に作用せるものであり、バッカル剤は口腔粘膜から薬物を徐々に吸収させて全身作用をもたらすことを目的としているが、これらはいずれも口腔内の保有時間が比較的短かいため薬物吸収量の点でからずしも充分といえない。

さらに全身的作用を目的とする薬物の投与には経口投与、注射などが一般的であるが、経口投与では消化管における分解の早いものや吸収されて

が50～60%と高く濡れ状態の歯肉粘膜への接着性が乏しいためすぐに剥れてしまう欠点があるのみならず、その厚みが大きいため適用に際し違和感が著しい。またテープ剤のように水分を含まず強力な接着力を有する接着剤を配合したものでは接着力が強すぎるため歯肉をいためるほか、唾液による濡れのため早急に接着力を失ない長時間歯肉粘膜上に保持せざることが困難である。

本発明者らは、これら皮膚に適用されている貼付剤と異なり、歯肉粘膜に適用した場合にも唾液による濡れにも影響されず長時間貼付が可能でありしかも歯肉に対する刺戟や装着時に違和感のない歯肉粘膜用貼付剤をえるべく種々研究を重ねた結果、柔軟性を有する支持体上に薬物を含有する特定の薬剤層をシート状に横層成形してえられる貼付剤が、歯肉粘膜に適用した場合にも唾液などの影響を受けることなく長時間口腔内に保持することができ、歯肉上の炎症部位を物理化学的刺戟から保護するとともに薬物を効率的に吸収し、局所的ならびに全身的な薬物投与に優れたものであ

るも体内での代謝の早いものの場合に適当でなく、また注射では副作用のため投与しえない場合も多い。近年においてそのような問題のある薬物の新しい投与経路として経皮吸収が注目され皮膚表面に薬物を含有するテープ剤、バップ剤などの各種貼付剤を貼り、薬物を皮膚表面から吸収させることが提案されている。しかしながら、このような経皮吸収、ことに表皮からの吸収の場合、皮膚の角質層の個人差、年令差、性別、貼付部位、貼付後の状態などにより薬物の吸収量、吸収速度が大きく影響を受ける欠点がある。

このような事情のもとに、本発明者らは口腔内の歯肉粘膜からの薬物の吸収が比較的良好なことに着目し、これに薬物含有貼付剤を適用することにより局所的のみならず全身的に作用しうると考え、歯肉粘膜用貼付剤について検討した。しかしながら歯肉は常に唾液などによつて漏れた状態にあるため、従来皮膚に適用されている貼付剤ではそのまま歯肉粘膜に適用するには種々の難点を有する。例えば、バップ剤などでは一般に水分含量

ることを見い出し、本発明を完成するに至つた。

すなわち、本発明は柔軟性のある支持体上に水溶性または水膨潤性高分子物質の1種または2種以上から主としてなる組成物に薬物を配合してなる薬剤層をシート状に横層成形してえられる歯肉粘膜用貼付剤を提供するものである。

本発明で用いられる支持体としては、ナイロン、ピニロンなどで作られる不織布、リント布、紙、塩化ビニルフィルム、ポリウレタンフィルム、エチレン-酢酸ビニル共重合体フィルム、その他のプラスチックフィルムなど柔軟性を有するものはすべて用いられ、また紙などの耐水性に乏しいものの場合は表面に常法によつて保護コーティングを行なつたものが好ましい。その厚みはとくに制限されないが、口腔内に貼付剤を適用した場合に異物感を与えないようできるだけ薄いものが好ましく、例えば10～100μ、さらに好ましくは20～70μ程度のものが選ばれる。

薬剤層形成用の基剤組成物に用いられる水溶性または水膨潤性高分子物質としては、ゼラチン、